

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number : **11-180957**

(43) Date of publication of application : **06.07.1999**

(51) Int.CI.

**C07D213/82**

**A01N 43/40**

(21) Application number : **09-354840**

(71) Applicant : **SUMITOMO CHEM CO LTD**

(22) Date of filing : **24.12.1997**

(72) Inventor : **SUGIHARA TERUKAZU  
SHUDO AKIRA  
TSUCHIYA TORU**

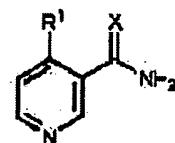
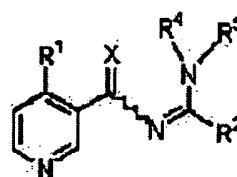
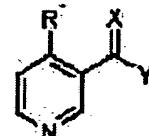
**(54) AMIDINE DERIVATIVE, ITS PRODUCTION AND HARMFUL ANIMAL-CONTROLLING AGENT CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT**

**(57) Abstract:**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain the subject new compound providing an excellent harmful animal-controlling effect.

**SOLUTION:** This compound is shown by formula I {X is O or S; Y is -NHC (R2)=NOR3 group, -N=C(R2)N(R4)}

(R5) group [R2 to R5 are each e.g. H or (substituted) alkyl]; and R1 is a haloalkyl}, e.g. N1,N1-dimethyl-N2-(4-trifluoromethylpyridine-3-carbonyl)amidine. A compound of formula I is obtained by reacting 1 mol. of amidine derivative of formula II with 1.0 to 3.0 mol. of compound of formula III or its salt (e.g. a salt resulted from reacting with an acid, such as hydrochloride or sulfate) in a solvent (e.g. tetrahydrofuran or dioxane) at -20 to 50°C for 1 to 30 hrs. The reaction liquid after the completion of the reaction is subjected to neutralization, organic solvent extraction, concentration or the like. A compound of formula II is obtained by reacting a compound of formula III with a compound of the formula (R4)(R5)N-C (R2)(OMe)2.



**LEGAL STATUS**

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

**Best Available Copy**

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平11-180957

(43)公開日 平成11年(1999)7月6日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup>  
C 07 D 213/82  
A 01 N 43/40

識別記号  
101

F I  
C 07 D 213/82  
A 01 N 43/40

101C

審査請求 未請求 請求項の数11 OL (全 10 頁)

(21)出願番号 特願平9-354840

(22)出願日 平成9年(1997)12月24日

(71)出願人 000002093  
住友化学工業株式会社  
大阪府大阪市中央区北浜4丁目5番33号  
(72)発明者 杉原 輝一  
兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化  
学工業株式会社内  
(72)発明者 首藤 晶  
兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化  
学工業株式会社内  
(72)発明者 土屋 亨  
兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化  
学工業株式会社内  
(74)代理人 弁理士 久保山 隆 (外1名)

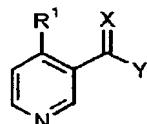
(54)【発明の名称】アミジン誘導体、その製造法及びそれを有効成分とする有害動物防除剤

(57)【要約】

【課題】本発明は有害動物に対して優れた防除効力を示す化合物を提供することを課題とする。

【解決手段】一般式 化1

【化1】

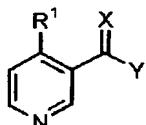


[式中、Xは酸素原子または硫黄原子を表し、Yは-NHC(R<sup>2</sup>)=NOR<sup>3</sup>基または-N=C(R<sup>2</sup>)N(R<sup>4</sup>)(R<sup>5</sup>)基を表し、R<sup>1</sup>はハロアルキル基を表し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は同一または相異なり、水素原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよい複素環基を表す。]で示されるアミジン誘導体。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】一般式 化1

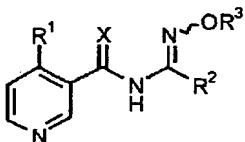
【化1】



「式中、Xは酸素原子または硫黄原子を表し、Yは-NHC(R²)=NOR³基または-N=C(R²)N(R⁴)(R⁵)基を表し、R¹はハロアルキル基を表し、R²、R³、R⁴及びR⁵は同一または相異なり、水素原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよい複素環基を表す。」で示されるアミジン誘導体。

## 【請求項2】一般式 化2

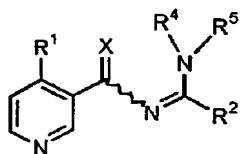
【化2】



「式中、X、R¹、R²及びR³は前記と同じ意味を表す。」で示される請求項1に記載のアミジン誘導体。

## 【請求項3】一般式 化3

【化3】



「式中、X、R¹、R²、R⁴及びR⁵は前記と同じ意味を表す。」で示される請求項1に記載のアミジン誘導体。

【請求項4】前記一般式 化1において、R¹がトリフルオロメチル基である請求項1記載のアミジン誘導体。

【請求項5】前記一般式 化2において、R¹がトリフルオロメチル基である請求項2記載のアミジン誘導体。

【請求項6】前記一般式 化2において、R¹がトリフルオロメチル基であり、Xが酸素原子である請求項2記載のアミジン誘導体。

【請求項7】前記一般式 化3において、R¹がトリフルオロメチル基である請求項3記載のアミジン誘導体。

【請求項8】前記一般式 化3において、R¹がトリフルオロメチル基であり、Xが酸素原子である請求項3記載のアミジン誘導体。

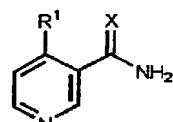
【請求項9】請求項3記載の一般式 化3で示されるアミジン誘導体と一般式 化4

【化4】NH₂OR³

【式中、R³は請求項1と同じ意味を表わす。】で示される化合物またはその塩とを反応させることを特徴とする、請求項2記載の一般式 化2で示されるアミジン誘導体の製造方法。

## 【請求項10】一般式 化5

【化5】



「式中、X及びR¹は請求項1と同じ意味を表わす。」で示される化合物と一般式 化6

【化6】(R⁴)(R⁵)N-C(R²)(OMe)₂

【式中、R²、R⁴及びR⁵は請求項1と同じ意味を表わす。】で示される化合物とを反応させることを特徴とする請求項3記載の一般式化 3で示されるアミジン誘導体の製造方法。

【請求項11】請求項1～8のいずれかに記載のアミジン誘導体を有効成分として含有することを特徴とする有害動物防除剤。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明はアミジン誘導体、その製造法及びそれを有効成分とする有害動物防除剤に関する。

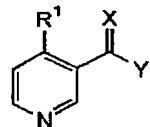
## 【0002】

【発明が解決しようとする課題】本発明は有害動物に対して優れた防除効力を示す化合物を提供することを課題とする。

## 【0003】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、鋭意検討した結果、下記一般式 化7で示されるアミジン誘導体が有害動物に対して優れた防除効力を示すことを見出し、本発明に至った。即ち、本発明は、一般式 化7

【化7】



【式中、Xは酸素原子または硫黄原子を表し、Yは-NHC(R²)=NOR³基または-N=C(R²)N(R⁴)(R⁵)基を表し、R¹はハロアルキル基を表し、R²、R³、R⁴及びR⁵は同一または相異なり、水素原子、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよい複素環基を表す。】で示されるアミジン誘導体（以下、本発明化合物と記す。）、その製造法及びそれを有効成分とする有害動物防除剤を提供する。

## 【0004】

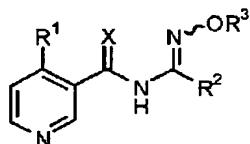
【発明の実施の形態】本発明において、R<sup>1</sup>で示されるハロアルキル基としては、C1～C3ハロアルキル基があげられ、有害動物に対する防除効力の点から、好ましくはC1～C2ハロアルキル基があげられ、より好ましくはトリフルオロメチル基があげられる。R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示されるアルキル基としては、メチル基、エチル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等の分岐していくてもよいC1～C6アルキル基があげられ、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示されるアルケニル基としては、エテニル基、プロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基等の分岐していくてもよいC2～C6アルケニル基があげられ、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示されるアルキニル基としては、エチニル基、プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基、ヘキシニル基等の分岐していくてもよいC2～C6アルキニル基があげられ、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示されるアリール基としては、フェニル基、ナフチル基等があげられ、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示される複素環基としては、ピリジル基、チエニル基、フリル基、ピラジニル基、チアゾリル基、イソオキサゾリル基、キノリル基等の、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～3個のヘテロ原子を含む5員又は6員の単環式基又はフェニル縮合環式基があげられる。R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>で示される、置換していくてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアリール基または置換されていてもよい複素環基に於ける置換基としては、ハロゲン原子、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基（該フェニル基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ニトロ基、ハロアルキル基またはフェノキシ基で置換されていてもよい）、フェノキシ基、フェニルチオ基、シクロアルキル基、シクロアルコキシ基があげられる。

【0005】本発明化合物は、有害動物に対する防除効力の点から、R<sup>1</sup>がトリフルオロメチル基、Xが酸素原子である化合物が好ましく、好ましい化合物の具体例としてはN<sup>2</sup>-ヒドロキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン、N<sup>2</sup>-メトキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン、N<sup>2</sup>-エトキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン、N<sup>2</sup>-ヒドロキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アセトアミジン、N<sup>2</sup>-メトキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アセトアミジン、N<sup>2</sup>-エトキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アセトアミジンがあげられる。本発明化合物には、C=N結合に基づく幾可異性体が存在し、置換基によっては、さらに、二重結合に由来する幾可異性体、不斉炭素に由來

する光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合があるが、本発明化合物には、これらの異性体及びその混合物も含まれる。

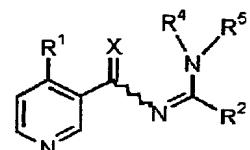
## 【0006】本発明化合物の中、一般式 化8

## 【化8】



[式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は前記と同じ意味を表す。]で示される化合物は、一般式 化9

## 【化9】



[式中、X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は前記と同じ意味を表す。]で示される化合物と一般式 化10

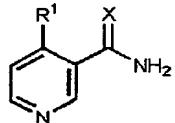
【化10】NH<sub>2</sub>OR<sup>3</sup>

[式中、R<sup>3</sup>は前記と同じ意味を表わす。]で示される化合物またはその塩とを反応させることにより製造することができる。該反応は、通常溶媒中で行われ、反応温度の範囲は通常-20℃～50℃であり、反応時間の範囲は通常1～30時間である。溶媒としては、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、酢酸等のプロトン性極性溶媒、アセトニトリル等のニトリル類あるいはこれらの混合溶媒が挙げられる。反応に供される試剤の量は、一般式 化9で表される化合物1モルに対し、一般式 化10で示される化合物またはその塩は1.0～3.0モルの割合である。一般式 化10で示される化合物の塩としては、塩酸塩、硫酸塩等の酸との塩があげられ、該塩を反応に供する場合は、該塩に対しほぼ等モルの塩基を使用する。かかる塩基としては、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン等の3級アミン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド等があげられる。反応終了後の反応液は中和、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理操作を行うことにより、一般式 化8で示される本発明化合物を得ることができる。該化合物は、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等によりさらに精製することも出来る。尚、一般式 化10で示される化合物は、例えば、BULLETIN DE L'ACADEMIE POLONAISE DES SCIENCES Vol. XXII, No. 3, p 195～199 (1974) に記載の方法に準じて製造することが出

来る。

【0007】本発明化合物の中、一般式 化9で示される化合物は、一般式 化11

【化11】



[式中、X及びR¹は前記と同じ意味を表す。] で示される化合物と一般式 化12

【化12】(R⁴)(R⁵)N-C(R²)(OMe)₂  
[式中、R²、R⁴及びR⁵は請求項1と同じ意味を表わす。] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。該反応は、通常無溶媒あるいは溶媒中で行われ、反応温度の範囲は通常10°C～180°Cであり、反応時間の範囲は通常1～30時間である。溶媒としてはジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類あるいはこれらの混合溶媒があげられる。反応に供される試剤の比は、一般式 化11で表される化合物1モルに対し、一般式 化12で示される化合物は1.0～3.0モルの割合である。反応終了後の反応液は、濃縮等の通常の後処理操作を行うことにより、一般式化9で示される本発明化合物を得ることができる。該化合物は、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等によりさらに精製することも出来る。

【0008】一般式化 11で示される化合物の中、Xが酸素原子である化合物は、モノエチルマロン酸エステルとハロゲン置換脂肪族酸クロリドとからハロゲン置換β-ケトエステルを製造し(Org. Synth., 61, 5～8 (1982) に記載の方法に準ずる)、ついで、該ハロゲン置換β-ケトエステルとα-シアノアセトアミドとから4段階を経て製造することができる(J. Org. Chem., 25, 560～564 (1968) に記載の方法に準ずる)。一般式化 11で示される化合物の中、Xが硫黄原子である化合物は、Xが酸素原子である化合物と五硫化リンとを反応させることにより製造することができる(Liebigs Ann. Chem., 716, 209～211 (1968) またはJ. Am. Chem. Soc., 87, 51～60 (1965) に記載の方法に準ずる)。尚、4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボキサミド及び4-トリフルオロメチルピリジン-3-チオカルボキサミドは市販のものを用いることができる。また、一般式 化12で示される化合物は、例えばCan. J. Chem., 50, 233～245 (1972) に記載の方法に準じて製造することができる。

【0009】本発明化合物が防除効力を示し得る有害動物としては、例えば下記の有害昆虫類、線虫類、ダニ類

等があげられる。

半翅目害虫

ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Nilaparvatalugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)などのウンカ類、ツマグロヨコバイ (Nephrotettix cincticeps)、タイワンツマグロヨコバイ (Nephrotettixvirescens)などのヨコバイ類、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)などのアブラムシ類、カメムシ類、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)、シルバーリーフコナジラミ (Bemisia argentifolii)などのコナジラミ類、カイガラムシ類、グンバイムシ類、キジラミ類など

鱗翅目害虫

ニカメイガ (Chilo suppressalis)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、ヨーロッピアンコーンボーラー (Ostrinia nubilalis)、シバツトガ (Parapediasia teterrella)、ワタノメイガ (Notarcha derogata)、ノシメマダラメイガ (Plodia interpunctella)などのメイガ類、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、アワヨトウ (Pseudaletia separata)、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、タマナヤガ (Agrotis ipsilon)、トリコブルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属などのヤガ類、モンシロチョウ (Pieris rapae crucivora)などのシロチョウ類、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (Grapholita molesta)、コドリングモス (Cydia pomonella)などのハマキガ類、モモシンクイガ (Carposina niponensis)などのシンクイガ類、リオネティア属などのハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属などのドクガ類、コナガ (Plutellaxylostella)などのスガ類、ワタアカミムシ (Pectinophora gossypiella)などのキバガ類、アメリカシロヒトリ (Hyphantria cunea)などのヒトリガ類、イガ (Tinea translucens)、コイガ (Tineola bisselliella)などのヒロズコガ類など

双翅目害虫

アカイエカ (Culex pipiens pallens)、コガタアカイエカ (Culex tritaeniorhynchus)などのイエカ類、Aedes aegypti、Aedes albopictusなどのエーデス属、Anopheles sinensisなどのアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (Muscadomestica)、オオイエバエ (Muscina stabulans)などのイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (Delia platura)、タマネギバエ (Delia antiqua)などのハナバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ブユ類、アブ類、サシバエ類、ハモグリバエ類など

鞘翅目害虫

ウエスタンコーンルームワーム (Diabrotica virgifera virgifera)、サザンコーンルートワーム (Diabrotica undecimpunctata howardi)などのコーンルートワーム

類、ドウガネブイブイ (Anomala cuprea)、ヒメコガネ (Anomala rufocuprea)などのコガネムシ類、メイズウイービル (Sitophilus zeamais)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、アルファルファタコゾウムシ (Hypera pastica)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chienensis)などのゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ (Tribolium castaneum)などのゴミムシダマシ類、ウリハムシ (Aulacophorafemoralis)、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata)、コロラドハムシ (Lepinotarsa decemlineata)などのハムシ類、シバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintioctopunctata)などのエビラクナ類、ヒラタキクイムシ類、ナガシンクイムシ類、カミキリムシ類、アオバアリガタハネカクシ (Paederus fuscipes)など直翅目網翅類害虫

チャバネゴキブリ (Blattella germanica)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、トビイロゴキブリ (Periplaneta brunnea)、トウヨウゴキブリ (Blatta orientalis)など

#### アザミウマ目害虫

ミナミキイロアザミウマ (Thrips palmi)、ネギアザミウマ (Thrips tabaci)、ハナアザミウマ (Thrips hawaiiensis)などのスリップス属、ヒラズハナアザミウマ (Frankliniella intonsa)、ミカンキイロアザミウマ (Frankliniella occidentalis)などのFrankliniella属膜翅目害虫

アリ類、スズメバチ類、アリガタバチ類、ニホンカブラバチ (Athalia japonica)などのハバチ類など

#### 直翅目害虫

ケラ類、バッタ類等

隠翅目害虫ヒトノミ (Pulex irritans)等

#### シラミ目害虫

コロモジラミ (Pediculus humanus corporis)、ケジラミ (Phthirus pubis)など

#### シロアリ目害虫

ヤマトシロアリ (Reticulitermes speratus)、イエシロアリ (Coptotermes formosanus)など

#### ダニ類

ナミハダニ (Tetranychus urticae)、カンザワハダニ (Tetranychus kanzawai)、ミカンハダニ (Panonychus citri)、リンゴハダニ (Panonychus ulmi)、オリゴニカス属などのハダニ類、ミカンサビダニ (Aculops plekassi)、チャノサビダニ (Calacarus carinatus)などのフシグダニ類、チャノホコリダニ (Polyphagotarsone mus latus)などのホコリダニ類、ヒメハダニ類、ケナガハダニ類、Boophilus microplusなどのマダニ類、コナダニ類、Pyroglyphidae、ツメダニ類、ワクモ類などの室内塵性ダニ類など

#### 線虫類

ハリセンチュウ目 (Tylenchida)

プラティレンクス科 (Pratylenchidae)

ミナミネグサレセンチュウ (Pratylenchus coffeae)

キタネグサレセンチュウ (Pratylenchus fallax)

チャネグサレセンチュウ (Pratylenchus loosi)

クルミネグサレセンチュウ (Pratylenchus vulnus)

ヘテロデラ科 (Heteroderidae)

ダイズシストセンチュウ (Heterodera glycines)

ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)

メロイドギネ科 (Meloidogynidae)

キタネコブセンチュウ (Meloidogyne hapla)

サツマイモコブセンチュウ (Meloidogyne incognita)

また、本発明化合物は有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤などの市販殺虫剤に抵抗性を示す上記有害昆虫類、線虫類、ダニ類に対しても有効である。

【0010】本発明化合物を有害動物防除剤（殺虫、殺線虫、殺ダニ剤等）の有効成分として用いる場合は、他の何らの成分を加えず、そのまま使用してもよいが、通常は、固体担体、液体担体、ガス状担体、餅等と混合し、必要あれば界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、水和剤、水中懸濁剤・水中乳濁剤等のフロアブル剤、粒剤、粉剤、エアゾール、自己燃焼型燐煙剤・化学反応型燐煙剤・多孔セラミック板燐煙剤等の加熱燐煙剤、ULV剤、毒餌等に製剤して使用する。これらの製剤には、有効成分として本発明化合物を通常、重量比で0.01%～95%含有する。

【0011】かかる製剤化の際に用いられる固体担体としては、たとえば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、合成含水酸化珪素、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）、化学肥料（硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等）等の微粉末あるいは粒状物等があげられ、液体担体としては、たとえば水、アルコール類（メタノール、エタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、ジメチルスルホキシド、大豆油、錦実油等の植物油等があげられ、ガス状担体、すなわち噴射剤としては、たとえばフロンガス、ブタンガス、LPG（液化

石油ガス)、ジメチルエーテル、炭酸ガス等があげられる。界面活性剤としては、たとえばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類およびそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体等があげられる。固着剤や分散剤等の製剤用補助剤としては、たとえばカゼイン、ゼラチン、多糖類(でんぶん粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等)、リグニン誘導体、ペントナイト、糖類、合成水溶性高分子(ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等)等があげられ、安定剤としては、たとえばPAP(酸性りん酸イソプロピル)、BHT(2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール)、BHA(2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物)、植物油、鉱物油、界面活性剤、脂肪酸またはそのエステル等があげられる。自己燃焼型煙草剤の基材としては、たとえば硝酸塩、亜硝酸塩、グアニジン塩、塩素酸カリウム、ニトロセルロース、エチルセルロース、木粉などの燃焼発熱剤、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、重クロム酸塩、クロム酸塩などの熱分解剤、硝酸カリウムなどの酸素供給剤、メラミン、小麦デンプンなどの支燃剤、硅藻土などの增量剤、合成糊料などの結合剤等があげられる。化学反応型煙草剤の基材としては、たとえばアルカリ金属の硫化物、多硫化物、水硫化物、含水塩、酸化カルシウム等の発熱剤、炭素質物質、炭化鉄、活性白土などの触媒剤、アゾジカルボンアミド、ベンゼンスルホニルヒドラジド、ジニトロベンタメチレンテトラミン、ポリスチレン、ポリウレタン等の有機発泡材、天然繊維片、合成繊維片等の充填剤等があげられる。毒餌の基材としては、たとえば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチニ酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ粉末等の誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料、ピーナッツオイルなどの誘引剤等があげられる。フロアブル剤(水中懸濁剤または水中乳濁剤)の製剤は、一般に1~75%の本発明化合物を0.5~15%の分散剤、0.1~10%の懸濁助剤(たとえば、保護コロイドやチクソトロピー性を付与する化合物)、0~10%の適当な補助剤(たとえば、消泡剤、防錆剤、安定化剤、展着剤、浸透助剤、凍結防止剤、防菌剤、防黴剤等)を含む水中で微小に分散させることによって得られる。水の代わりに化合物がほとんど溶解しない油を用いて油中懸濁剤とすることも可能である。保護コロイドとしては、たとえばゼラチン、カゼイン、ガム類、セルロースエーテル、ポリビニルアルコール等が用いられる。チクソトロピー性を付与する化合物としては、たとえばペントナイト、アルミニウムマグネシウムシリケート、キサンタンガム、

ポリアクリル酸等があげられる。

【0012】このようにして得られる製剤は、そのままあるいは水等で希釈して用いる。また、他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤、動物用飼料等と混用または併用することもできる。かかる他の殺虫剤および/または殺ダニ剤および/または殺線虫剤としては、例えばフェニトロチオン[O, O-ジメチル-O-(3-メチル-4-ニトロフェニル)ホスホロチオエート]、フェニチオン[O, O-ジメチル-O-(3-メチル-4-(メチルチオ)フェニル)ホスホロチオエート]、ダイアジノン[O, O-ジエチル-O-2-イソプロピル-6-メチルピリミジン-4-イルホスホロチオエート]、クロルビリホス[O, O-ジエチル-O-3, 5, 6-トリクロロ-2-ビリジルホスホロチオエート]、アセフェート[O, S-ジメチル-N-アセチルホスホロアミドチオエート]、メチダチオン[S-2, 3-ジヒドロ-5-メトキシ-2-オキソ-1, 3, 4-チアジアゾール-3-イルメチル-O, O-ジメチルホスホロジチオエート]、エチルチオメトン[O, O-ジエチル-S-2-エチルチオエチルホスホロチオエート]、DDVP[2, 2-ジクロロビニルジメチルホスフェート]、スルプロホス[O-エチル-O-4-(メチルチオ)フェニル-S-プロピルホスホロジチオエート]、シアノホス[O-4-シアノフェニル-O, O-ジメチルホスホロチオエート]、ジオキサベンゾホス[2-メトキシ-4H-1, 3, 2-ベンゾジオキサホスフィニン-2-スルフィド]、ジメトエート[O, O-ジメチル-S-(N-メチルカルバモイルメチル)ジチオホスフェート]、フェントエート[エチル-2-ジメトキシホスフィノチオイルチオ(フェニル)アセテート]、マラチオン[ジエチル(ジメトキシホスフィノチオイルチオ)サクシネート]、トリクロルホン[ジメチル-2, 2, 2-トリクロロ-1-ヒドロキシエチルホスホネート]、アジンホスメチル[S-3, 4-ジヒドロ-4-オキソ-1, 2, 3-ベンゾトリアジン-3-イルメチル-O, O-ジメチルホスホロジチオエート]、モノクロトホス[ジメチル(E)-1-メチル-2-(メチルカルバモイル)ビニルホスフェート]、エチオン[O, O, O', O'-テトラエチル-S, S'-メチレンビス(ホスホロジチオエート)]ホスチアゼート[N-(O-メチル-S-sec-ブチル)ホスホリチアゾリンジ-2-オン]等の有機リン系化合物、BPMC(2-sec-ブチルフェニル-N-メチルカーバメート)、ベンフラカルブ[エチル-N-(2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチルベンゾフラン-7-イルオキシカルボニル(メチル)アミノチオ)-N-イソプロピル-β-アラニネート]、プロポキスル[2-イソプロポキシフェニル-N-メチルカルバメート]、カルボスルファン[2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-7-

ベンゾ[b]フラニル N-ジブチルアミノチオ-N-メチルカーバメート]、カルバリル[1-ナフチル-N-メチルカーバメート]、メソミル[S-メチル-N-[メチルカルバモイル]オキシ]チオアセトイミデート]、エチオフェンカルブ[2-(エチルチオメチル)フェニルメチルカーバメート]、アルジカルブ[2-メチル-2-(メチルチオ)プロピオンアルデヒド O-メチルカルバモイルオキシ]、オキサミル[N, N-ジメチル-2-メチルカルバモイルオキシイミノ-2-(メチルチオ)アセタミド]、フェノチオカルブ[S-4-フェノキシブチル]-N, N-ジメチルチオカーバメート等のカーバメート系化合物、エトフェンプロックス[2-(4-エトキシフェニル)-2-メチルプロピル-3-フェノキシベンジル エーテル]、フェンバレート[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (RS)-2-(4-クロロフェニル)-3-メチルブチレート]、エスフェンバレート[(S)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (S)-2-(4-クロロフェニル)-3-メチルブチレート]、フェンプロパトリル[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル 2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート]、シペルメトリン[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (1RS, 3RS)-(1RS, 3RS)-3-(2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、ペルメトリン[3-フェノキシベンジル (1RS, 3RS)-(1RS, 3RS)-3-(2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-メチルシクロプロパンカルボキシレート]、シハロトリル[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (Z)-(1RS, 3RS)-3-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフロオロプロペニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、デルタメトリン[(S)- $\alpha$ -シアノ-m-フェノキシベンジル (1R, 3R)-3-(2, 2-ジプロモビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、シクロプロトリン[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (RS)-2, 2-ジクロロ-1-(4-エトキシフェニル)シクロプロパンカルボキシレート]、フルバリネット[(RS)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル N-(2-クロロ- $\alpha$ ,  $\alpha$ ,  $\alpha$ -トリフルオロー-p-トリル)-D-バリネット]、ビフェントリン[2-メチルビフェニル-3-イルメチル(Z)-(1RS)-cis-3-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロプロパー-1-エニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシラート]、アクリナトリン[(S)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (Z)-(1R, 3S)-2, 2-ジメチル-3-(2, 2, 2-トリフルオロメチルエトキシカルボニル)ビニル]シクロプロパンカルボキシラート]、ハルフェンプロックス[2-メチル-(4-ブロ

モジフルオロメトキシフェニル)-2-メチルプロピル-3-フェノキシベンジル エーテル]、トラロメトリン[(S)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (1R, 3S)-2, 2-ジメチル-3-(1, 2, 2, 2-テトラブロモエチル)]シクロプロパンカルボキシラート]、シラフルオフェン[4-エトキシフェニル(3-(4-フルオロー-3-フェノキシフェニル)プロピル)ジメチルシラン]等のビレスロイド化合物、ブロフェジン[2-tert-ブチルイミノ-3-イソプロピル-5-フェニル-3、4、5、6-テトラヒドロ-2H-1, 3, 5-チアジアジン-4-オン]等のチアジアジン誘導体、イミダクロプリド[1-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン]、アセタミプリド[(E)-N-(6-クロロ-3-ビリジル)メチル]-N-2-シアノ-N-メチルアセトアミジン]、ニテンピラム[(E)-N-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)-N-エチル-N'-メチル-2-ニトロビニリデンジアミン]等のネオニコチノイド類、カルタップ(S, S'-(2-ジメチルアミノトリメチレン)ビス(チオカーバメート)]、チオシクラム[N, N-ジメチル-1, 2, 3-トリチアン-5-イルアミン]、ベンスルタップ(S, S'-(2-ジメチルアミノトリメチレン)ジ(ベンゼンチオスルホナート)]等のネライストキシン誘導体、N-シアノ-N'-メチル-N'-(6-クロロ-3-ビリジルメチル)アセトアミジン等のN-シアノアミジン誘導体、エンドスルファン(6, 7, 8, 9, 10, 10-ヘキサクロロ-1, 5, 5a, 6, 9, 9a-ヘキサヒドロ-6, 9-メタノ-2, 4, 3-ベンゾジオキサチエピン 3-オキサイド]、r-BHC(1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサクロロシクロヘキサン)、1, 1-ビス(クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素化合物、クロルフルアズロン[1-(3, 5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)フェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]、テフルベンズロン[1-(3, 5-ジクロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]、フルフェノクスロン[1-(4-(2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-フルオロフェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、アミトラズ[N-メチルビス(2, 4-キシリイミノメチル)アミン]、クロルジメホルム[N'--(4-クロロ-2-メチルフェニル)-N, N-ジメチルホルムアミジン]等のホルムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン[N-(2, 6-ジイソプロピル-4-フェノキシフェニル)-N'-tert-ブチルカルボジイミド]等のチオ尿素誘導体、N-フェニルピラゾール誘導体、テブフェノジド[N-tert-

ブチル-N'-(4-エチルベンゾイル)-3,5ジメチルベンゾヒドラジド]、クロルフェナビル[4-ブロモ-2-(4-クロロフェニル)-1-エトキシメチル-5-(トリフルオロメチル)ピロール-3カルボニル]、プロモプロピレート[イソプロピル-4,4'-ジプロモベンジレート]、テトラジホン[4-クロロフェニル-2,4,5-トリクロロフェニルスルホン]、キノメチオネット[S,S-6-メチルキノキサン-2,3-ジイルジオカルボネット]、プロパルゲイト[2-(4-tert-ブチルフェノキシ)シクロヘキシル-2-プロピニルスルファイト]、フェンブタテン オキシド[ビス[トリス(2-メチル-2-フェニルプロピル)ティン]オキシド]、ヘキシチアゾクス[(4RS,5RS)-5-(4-クロロフェニル)-N-クロロヘキシル-4-メチル-2-オキソ-1,3-チアゾリジン-3-カルボキサミド]、クロフェンテジン[3,6-ビス(2-クロロフェニル)-1,2,4,5-テトラジン]、ピリダベン[2-tert-ブチル-5-(4-tert-ブチルベンジルチオ)-4-クロロピリジン-3(2H)-オン]、フェンピロキシメート[tert-ブチル(E)-4-[(1,3-ジメチル-5-フェノキシビラゾール-4-イル)メチレンアミノオキシメチル]ベンゾエート]、テブフェンピラド[N-4-tert-ブチルベンジル]-4-クロロ-3-エチル-1-メチル-5-ピラゾールカルボキサミド]、ポリナクチンコンプレックス[テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン]、ミルベメクチン、アベルメクチン、イバーメクチン、アザジラクチン[AZAD]、ピリミジフェン[5-クロロ-N-[2-(4-(2-エトキシエチル)-2,3-ジメチルフェノキシ)エチル]-6-エチルピリミジン-4-アミン]、ピメトロジン[2,3,4,5-テトラヒドロ-3-オキソ-4-[(ピリジン-3-イル)メチレンアミノ]-6-メチル-1,2,4-トリアジン]等があげられる。

【0013】本発明化合物を農園芸用有害動物防除剤として用いる場合、その施用量は、10アールあたり、通常1gから1000gの範囲であり、好ましくは10gから100gの範囲であり、乳剤、水和剤、フロアブル剤等を水で希釈して用いる場合は、その施用濃度は通常、10ppm~1000ppmであり、粒剤、粉剤等はそのまま施用する。本発明化合物を農園芸用有害動物防除剤として用いる場合、これらの製剤を有害動物から保護すべき作物等の植物に茎葉散布してもよいが、本発明化合物は浸透移行性を示すことから、これらの製剤を土壤に処理することにより、土壤に棲息する有害動物を防除することができるとともに、作物等の植物の茎葉部の有害動物をも同時に防除することができる。また、本発明化合物を防疫用有害動物防除剤として用いる場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は通常水で0.01ppm~

10000ppmに希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙煙剤、ULV剤、毒餌等はそのまま施用する。これらの施用量、施用濃度は、いずれも製剤の種類、施用時期、施用場所、施用方法、有害動物の種類、被害程度等の状況によって異なり、上記の範囲にかかわることなく増減させることができる。

#### 【0014】

【実施例】以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等により、さらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。まず、本発明化合物の製造例を示す。尚、化合物番号は後記表1~表2における化合物番号で示す。

#### 【0015】製造例1

4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボキサミド1.90g(10.0mmol)をクロロホルム25mlに懸濁させ、これに室温でN,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール2.18g(18.3mmol)を滴下し、3時間攪拌した。クロロホルムを減圧下に留去し、残渣をヘキサン-クロロホルム溶液にて晶析し、N<sup>1</sup>,N<sup>1</sup>-ジメチル-N<sup>2</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン(化合物番号15)2.37g(収率96.8%)を得た。

#### 【0016】製造例2

ヒドロキシルアミン塩酸塩0.265g(3.82mmol)を1規定水酸化ナトリウム水溶液3.82ml(3.82mmol)に溶解させ、これにN<sup>1</sup>,N<sup>1</sup>-ジメチル-N<sup>2</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン0.46g(1.91mmol)のジオキサン4ml溶液を加えた。氷水バス冷却下に該溶液に酢酸5mlを滴下した後、これを室温にて約1時間攪拌した。ジオキサンを減圧下に留去し、残渣に、水10mlを加えた後、氷水バス冷却下に炭酸カリウム粉末を加え、液性をpH8~pH7に調製した。これを酢酸エチルにて2回抽出し、有機層を10%食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。硫酸マグネシウムを汎別後、減圧下に溶媒を留去し、N<sup>2</sup>-ヒドロキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン(化合物番号9)0.357g(収率80.2%)を得た。

#### 【0017】製造例3

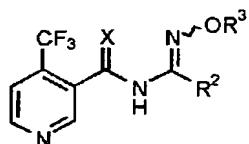
O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩0.300g(3.60mmol)を1規定水酸化ナトリウム水溶液3.60ml(3.60mmol)に溶解させ、これにN<sup>1</sup>,N<sup>1</sup>-ジメチル-N<sup>2</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン0.441g(1.80mmol)のジオキサン4ml溶液を加えた。氷水バス冷却下に該溶液に酢酸5mlを滴下した後、これを室温にて約1時間攪拌した。ジオキサンを減圧下に留去し、残渣に、水10mlを加えた後、氷水バス冷却下に炭酸カリウム粉末を加え、液性をpH8~pH7に調製

した。これを酢酸エチルにて2回抽出し、有機層を10%食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。硫酸マグネシウムを沪別後、減圧下に溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム/メタノール=20/1)にて精製し、N<sup>2</sup>-メトキシ-N<sup>1</sup>-(4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボニル)アミジン(化合物番号10)0.271g(収率60.9%)を得た。

【0018】次に、本発明化合物の例を化合物番号及び物性値(融点または屈折率)と共に表1~表2に記す。(尚、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、P

rはプロピル基を、Buはブチル基を、Phはフェニル基を、iはイソを、tはターシャリーをそれぞれ表わす。)

【0019】



で示される化合物

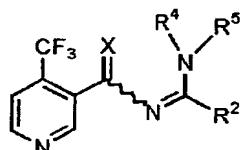
【表1】

化合物番号	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性値
1	O	Me	H	m.p. 125°C
2	O	Me	Me	m.p. 43°C
3	O	Me	Et	m.p. 66°C
4	O	Me	i-Pr	m.p. 51°C
5	O	Me	t-Bu	m.p. 68°C
6	O	Me	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	n <sub>D</sub> <sup>25</sup> 1.49
7	O	Me	i-Bu	m.p. 62°C
8	O	Me	CH <sub>2</sub> Ph	m.p. 86°C
9	O	H	H	m.p. 174°C
10	O	H	Me	m.p. 139°C
11	O	H	Et	m.p. 106°C
12	O	H	i-Pr	n <sub>D</sub> <sup>25</sup> 1.49
13	O	H	t-Bu	m.p. 74°C
14	O	H	i-Bu	m.p. 83°C

【0020】

で示される化合物

【表2】



化合物番号	X	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物性値
15	O	H	Me	Me	m.p. 67°C
16	O	Me	Me	Me	n <sub>D</sub> <sup>25</sup> 1.52
17	S	H	Me	Me	n <sub>D</sub> <sup>25</sup> 1.65

【0021】次に、製剤例を示す。化合物番号は表1~表2に記載の番号であり、部は重量部を表わす。

製剤例1 乳剤

本発明化合物1~17の各々10部をキシレン35部お

およびジメチルホルムアミド3部に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル14部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム6部を加え、よく攪拌混合して各々の10%乳剤を得る。

#### 製剤例2 水和剤

本発明化合物1～17の各々20部をラウリル硫酸ナトリウム4部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、合成含水酸化珪素微粉末20部および珪藻土54部を混合した中に加え、ジュースミキサーで攪拌混合して各々の20%水和剤を得る。

#### 【0022】製剤例3 粒剤

本発明化合物1～17の各々5部にドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム5部、ベントナイト30部およびクレー60部を加え、充分攪拌混合する。次いで、これらの混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の5%粒剤を得る。

#### 製剤例4 粉剤

本発明化合物1～17の各々の1部を適量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末5部、PAP0.3部およびクレー93.7部を加え、ジュースミキサーで攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の1%粉剤を得る。

#### 【0023】製剤例5 フロアブル剤（水中乳濁剤）

本発明化合物1～17の各々の10部をポリビニルアルコール6部を含む水溶液40部中に加え、ミキサーで攪拌し、分散剤を得る。この中に、キサンタンガム0.05部およびアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液40部を加え、さらに、プロピレングリコール10部を加えて緩やかに攪拌混合して各々の10%水中乳濁剤を得る。

#### 製剤例6 油剤

本発明化合物1～17の各々の0.1部をキシレン5部およびトリクロロエタン5部に溶解し、これを脱臭灯油89.9部に混合して各々の0.1%油剤を得る。

#### 【0024】製剤例7 油性エアゾール

本発明化合物1～17の各々の0.1部、テトラメスリン0.2部、d-フェノスリン0.1部、トリクロロエタン10部および脱臭灯油59.6部を混合溶解し、エアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）30部を加圧充填して各々の油性エアゾールを得る。

#### 製剤例8 水性エアゾール

本発明化合物1～17の各々の0.2部、d-アレスリン0.2部、d-フェノスリン0.2部、キシレン5部、脱臭灯油3.4部および乳化剤（アトモス300

（アトラスケミカル社登録商標名）1部を混合溶解したものと、純水50部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付け、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）40部を加圧充填して各々の水性エアゾールを得る。

#### 【0025】製剤例9 毒餌

本発明化合物1～17の各々10mgをアセトン0.5mlに溶解し、この溶液を動物用固型飼料粉末（飼育繁殖用固型飼料粉末CE-2、日本クレア株式会社商品名）5gに処理し、均一に混合する。ついでアセトンを風乾し、各々の0.2%毒餌を得る。

【0026】次に、本発明化合物が有害動物防除剤の有効成分として有用であることを試験例により示す。

#### 試験例1 ワタアブラムシに対する殺虫試験（茎葉散布試験）

製剤例1に準じて得られた供試化合物の乳剤を、有効成分濃度が500ppmになるように水で希釈した。第1本葉が展開したポリエチレンカップ植えのキュウリの第1本葉にワタアブラムシ無翅胎生成虫を5頭接種した。1日後、ワタアブラムシの寄生したカップ植えのキュウリに上記希釈液を20ml/カップの割合で散布した。散布6日後に、虫数を調査し、数1により防除価を求めた。

#### 【数1】

$$\text{防除価 (\%)} = \left( 1 - \frac{\text{C}_b \times \text{T}_{a1}}{\text{T}_b \times \text{C}_{a1}} \right) \times 100$$

ここで、

C<sub>b</sub>：無処理区の処理前の虫数

C<sub>a1</sub>：無処理区の観察時の虫数

T<sub>b</sub>：実験区の処理前の虫数

T<sub>a1</sub>：実験区の観察時の虫数

である。その結果、本発明化合物1～17は各々防除価90%以上を示した。

#### 【0027】試験例2 ワタアブラムシに対する殺虫試験（浸透移行性試験）

製剤例1に準じて得られた供試化合物の乳剤を、有効成分濃度が500ppmになるように水で希釈した。ポリエチレンカップ植えのキュウリの株元に、該希釈液を10cc/1ポットの割合でかん注した。薬剤処理5日後に、ワタアブラムシ成虫を5頭本葉上に放飼し、放飼6日後に上記数1により防除価を求めた。その結果、本発明化合物1～17は各々防除価90%以上を示した。

【発明の効果】本発明化合物は有害動物防除剤として有用である。

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**